### PATENT COOPERATION TREATY

To:

#### From the INTERNATIONAL BUREAU

### **PCT**

NOTICE INFORMING THE APPLICANT OF THE COMMUNICATION OF THE INTERNATIONAL APPLICATION TO THE DESIGNATED OFFICES

(PCT Rule 47.1(c), first sentence)

KUTZENBERGER, Helga Kutzenberger & Wolff Theodor-Heuss-Ring 23 50668 Köln

**ALLEMAGNE** 

- 6. FE8. 2003

Date of mailing(day/month/year)
16 January 2003 (16.01.03)

Applicant's or agent's file reference

GRA3025PCT

IMPORTANT NOTICE

International application No. PCT/EP02/007380

International filing date(day/month/year) 03 July 2002 (03.07.02)

Priority date(day/month/year)
05 July 2001 (05.07.01)

Applicant

GRÜNENTHAL GMBH, et al

1. Notice is hereby given that the International Bureau has communicated, as provided in Article 20, the international application to the following designated Offices on the date indicated above as the date of mailing of this notice:

KP. KR. US

In accordance with Rule 47.1(c), third sentence, those Offices will accept the present notice as conclusive evidence that the communication of the international application has duly taken place on the date of mailing indicated above and no copy of the international application is required to be furnished by the applicant to the designated Office(s).

2. The following designated Offices have waived the requirement for such a communication at this time:

AE, AG, AL, AM, AP, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EA, EC, EE, EP, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OA, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW

The communication will be made to those Offices only upon their request. Furthermore, those Offices do not require the applicant to furnish a copy of the international application (Rule 49.1(a-bis)).

- Enclosed with this notice is a copy of the international application as published by the International Bureau on 16 January 2003 (16.01.03) under No. WO 03/004483.
- 4. TIME LIMITS for filing a demand for international preliminary examination and for entry into the national phase

The applicable time limit for entering the national phase will, subject to what is said in the following paragraph, be 30 MONTHS from the priority date, not only in respect of any elected Office if a demand for international preliminary examination is filed before the expiration of 19 months from the priority date, but also in respect of any designated Office, in the absence of filing of such demand, where Article 22(1) as modified with effect from 1 April 2002 applies in respect of that designated Office. For further details, see *PCT Gazette* No. 44/2001 of 1 November 2001, pages 19926, 19932 and 19934, as well as the *PCT Newsletter*, October and November 2001 and February 2002 issues.

In practice, time limits other than the 30-month time limit will continue to apply, for various periods of time, in respect of certain designated or elected Offices. For regular updates on the applicable time limits (20, 21, 30 or 31 months, or other time limit), Office by Office, refer to the PCT Gazette, the PCT Newsletter and the PCT Applicant's Guide, Volume II, National Chapters, all available from WIPO's Internet site, at http://www.wipo.int/pct/en/index.html.

For filing a demand for international preliminary examination, see the PCT Applicant's Guide, Volume I/A, Chapter IX. Only an applicant who is a national or resident of a PCT Contracting State which is bound by Chapter II has the right to file a demand for international preliminary examination (at present, all PCT Contracting States are bound by Chapter II).

It is the applicant's sole responsibility to monitor all these time limits.

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Authorized officer

Judith Zahra

Facsimile No.(41-22) 740.14.35

Telephone No.(41-22) 338.91.11

Form PCT/IB/308 (April 2002)

### PATENT COOPERATION TREATY

#### PCT

#### NOTIFICATION CONCERNING SUBMISSION OR TRANSMITTAL OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

KUTZENBERGER, Helga Kutzenberger & Wolff Theodor-Heuss-Ring'23 50668 Köln

05 July 2001 (05.07.01)

Germany

- 5. DEZ. 2002

IMPORTANT NOTIFICATION

Date of mailing (day/month/year)
11 November 2002 (11.11.02)

Applicant's or agent's file reference
GRA3025PCT
International application No.

International application No.

PCT/EP02/07380

International filing date (day/month/year)

International publication date (day/month/year)

Priority date (day/month/year)

**Applicant** 

GRÜNENTHAL GMBH et al

Not yet published

- 1. The applicant is hereby notified of the date of receipt (except where the letters "NR" appear in the right-hand column) by the International Bureau of the priority document(s) relating to the earlier application(s) indicated below. Unless otherwise indicated by an asterisk appearing next to a date of receipt, or by the letters "NR", in the right-hand column, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
- 2. This updates and replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents.
- 3. An asterisk(\*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b). In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
- 4. The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which was not received by the International Bureau or which the applicant did not request the receiving Office to prepare and transmit to the International Bureau, as provided by Rule 17.1(a) or (b), respectively. In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Priority date

Priority application No.

Country or regional Office or PCT receiving Office

Date of receipt of priority document

05 July 2001 (05.07.01)

101 32 725.0

DE

05 Augu 2002 (05.08.02)

The Int rnational Bureau of WIPO 34, chemin d s C I mbettes 1211 Geneva 20, Switzerland

P

Authorized officer

Pierrot CREPPY

\_

Telephone No. (41-22) 338.83.38

Form PCT/IB/304 (July 1998)

Facsimile No. (41-22) 740.14.35

005254181

# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

# **PCT**

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

<u>`</u>	Kei 16 Sowie negelii 45 diid 44		
Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts GRA3025PCT	WEITERES  siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5		
Internationales Aktenzeichen	Internationales Anmeldedatum	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)	
	(Tag/Monat/Jahr)	05/07/0001	
PCT/EP 02/07380	03/07/2002	05/07/2001	
Anmelder			
GRÜNENTHAL GMBH	<u> </u>		
Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem In	ternationalen Büro übermittelt.	chenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Blätter.	
Dieser internationale Recherchenbericht umfa    X   Darüber hinaus liegt ihm jev		blatter. icht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.	
Grundlage des Berichts			
		ndlage der internationalen Anmeldung in der Sprache n Punkt nichts anderes angegeben ist.	
Die internationale Recherch Anmeldung (Regel 23.1 b))	ne ist auf der Grundlage einer bei d durchgeführt worden.	ler Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen	
	n Anmeldung offenbarten <b>Nucleo</b> f Sequenzprotokolls durchgeführt wo	tid- und/oder Aminosāuresequenz ist die internationale	
	Idung in Schriflicher Form enthalte		
zusammen mit der internati	onalen Anmeldung in computerlesi	barer Form eingereicht worden ist.	
bei der Behörde nachträglic	h in schriftlicher Form eingereicht	worden ist.	
bei der Behörde nachträglic	ch in computerlesbarer Form einge	reicht worden ist.	
Die Erklärung, daß das nac internationalen Anmeldung	hträglich eingereichte schriftliche S im Anmeldezeitpunkt hinausgeht,	Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der wurde vorgelegt.	
Die Erklärung, daß die in co wurde vorgelegt.	omputerlesbarer Form erfaßten Info	ormationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen,	
2. Bestimmte Ansprüche ha	ben sich als nicht recherchierba	ır erwiesen (siehe Feld I).	
3. Mangelnde Einheitlichkei	t der Erfindung (siehe Feld II).		
Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfig	ndung		
wird der vom Anmelder ein	gereichte Wortlaut genehmigt.	•	
X wurde der Wortlaut von der	Behörde wie folgt festgesetzt:		
SUBSTITUIERTE Y-LACTON	/ERBINDUNGEN ALS NMDA	-ANTAGONISTEN	
5. Hinsichtlich der <b>Zusammenfassung</b>			
wurde der Wortlaut nach R	e innerhalb eines Monats nach de	ebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der m Datum der Absendung dieses internationalen	
6. Folgende Abbildung der Zeichnungen	ist mit der Zusammenfassung zu v	veröffentlichen: Abb. Nr.	
wie vom Anmelder vorgesc	hlagen	X keine der Abb.	
weil der Anmelder selbst ke	eine Abbildung vorgeschlagen hat.		
weil diese Abbildung die E	rfindung besser kennzeichnet.		

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/07380

Feld III

WORTLAUT DER ZUSAMMENFASSUNG (F rtsetzung von Punkt 5 auf Blatt 1)

Die vorliegende Erfindung betrifft substituierte  $\gamma$ -Lactonverbindungen, Verfahren zu deren Herstellung, Arzneimittel enthaltend diese Verbindungen sowie die Verwendung dieser Verbindungen zur Herstellung von Arzneimitteln.

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 02/07380

A. KLASSII IPK 7	FIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES C07D307/32 C07D405/12 A61K31/3	41 A61P23/00		
			·	
Nach der Int	ernationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klas	sifikation und der IPK	-	
	ACHIERTE GEBIETE			
IPK 7	ter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbo ${\tt C07D}$ .			
Recherchier	ne aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, so	weit diese unter die recherchierten Gebiete	fallen	
Während de	er internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (N	ame der Datenbank und evtl. verwendete S	Suchbegriffe)	
CHEM A	BS Data, EPO-Internal	·	·	
C. ALS WE	SENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN			
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe	e der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.	
x /	GONZALEZ, DAVID ET AL: "Chemoenz Synthesis of Unnatural Amino Acid Modified Claisen Rearrangement of Enolates. Approach to Morphine Sy	s via Glycine	1,3,4	
·	JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY (199 62(5), 1194-1195 , XP001097342 Seite 1195			
x <i>J</i>	PLUSQUELLEC, DANIEL: "Friedel-Cr reactions of.gammaarylgamma J. CHEM. RES., SYNOP. (1982), (2) XP001097650 Seite 46	lactones"	1,3,4	
		./		
		,		
	·		·	
			·	
	tere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu nehmen	Siehe Anhang Patentfamilie		
Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen:     A' Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der				
'E' älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist  Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist 'X' Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung				
*L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft er- scheinen zu tassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgrübte).  *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet				
ausgeführt)  'O' Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht  'P' Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmekdedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist  werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist  '&' Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist				
	Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Re		
2	. Oktober 2002	15/10/2002		
Name und	Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Bevollmächtigter Bediensteter  Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2			
	NL – 2280 HV Rijswijk Tel. (+31–70) 340–2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31–70) 340–3016	Grassi, D		

2

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 02/07380

		02/0/380		
C.(Fortsetz	ung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN			
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht komm	enden Teile	Betr. Anspruch Nr.	
x J	✓LUSQUELLEC, DANIEL ET AL: "Reactions of glyoxylic acid derivatives with olefins: syntheses of.alphasubstituted.gammalactones" BULL. SOC. CHIM. FR. (1979), (9-10, PT. 2), 552-8, XP001097998 Seite 553 Seite 556		1,3,4	
X	BEN-ISHAI, D. ET AL: "A new synthesis of amino acids. II. Amidoalkylation of olefins with glyoxylic acid derivatives" TETRAHEDRON (1977), 33(12), 1533-42, XP001095785 Beispiel 8C		1,3,4	
x	ALTMAN, JANINA ET AL: "Amino acid synthesis. II. Amidoalkylation of olefins with glyoxylic aci derivatives" TETRAHEDRON LETT. (1975), (43), 3737-40, XP001097977 Seite 3738	5	.3,4	
A /	FOSCOLOS G B ET AL: "SYNTHESIS AND PHARMACOLOGICAL STUDY OF SOME NEW BETA-(DIALKYLAMINOMETHYL)-GAMMA-BUTYROLACT ONES AND THEIR TETRAHYDROFURAN ANALOGUES" FARMACO, SOCIETA CHIMICA ITALIANA, PAVIA, IT, Bd. 1, Nr. 51, 1996, Seiten 19-26, XP000915050 ISSN: 0014-827X das ganze Dokument		.37	

### VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

# **PCT**

## INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts	WEITERES VORGEHEN S	iehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen
GRA3025PCT	WEITERES VONGENER V	orläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)
Internationales Aktenzeichen PCT/EP02/07380	Internationales Anmeldedatum (Tag 03.07.2002	MonatUahr) Prioritätsdatum (TagMonatUahr) 05.07.2001
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder C07D307/32	I nationale Klassifikation und IPK	
GRÜNENTHAL GMBH et al.		
Dieser internationale vorläufige Problem       beauftragten Behörde erstellt und	üfungsbericht wurde von der mit o wird dem Anmelder gemäß Artike	der internationalen vorläufigen Prüfung I 36 übermittelt.
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesar	nt 5 Blätter einschließlich dieses	Deckblatts.
und/oder Zeichnungen, die g	jeändert wurden und diesem Beric	s sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen cht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum
Diese Anlagen umfassen insgesa	mt Blätter.	
3. Dieser Bericht enthält Angaben zu	ı folgenden Punkten:	
I ⊠ Grundlage des Besche	eids	
II □ Priorität		
III   Keine Erstellung eines	Gutachtens über Neuheit, erfinde	rische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
IV   Mangelnde Einheitlich		g g verment and a contract and a con
V 🛭 Begründete Feststellur gewerblichen Anwend	ng nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlic parkeit; Unterlagen und Erklärung	h der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der en zur Stützung dieser Feststellung
VI 🛘 Bestimmte angeführte	Unterlagen	
VII □ Bestimmte Mängel der	internationalen Anmeldung	
VIII 🛘 Bestimmte Bemerkung	en zur internationalen Anmeldung	
Datum der Einreichung des Antrags	Datum der	Fertigstellung dieses Berichts
10.09.2002	05.11.20	003
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Bevollmächtigter Bediensteter		
Europäisches Patentamt D-80298 München	Grassi, [	
Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 52369	o6 epmu d	9 2399-8499

# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP02/07380

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)):

	Bes	schreibung, Seiten	
	1-4	1	in der ursprünglich eingereichten Fassung
	Ans	sprüche, Nr.	
	1-3	7	in der ursprünglich eingereichten Fassung
	Zei	chnungen, Blätter	
	1/2,	2/2	in der ursprünglich eingereichten Fassung
<ol> <li>Hinsichtlich der Sprache: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.</li> </ol>			
	Die eing	Bestandteile stander gereicht; dabei hande	n der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache elt es sich um
		die Sprache der Übe Regel 23.1(b)).	ersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach
		die Veröffentlichung	ssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
		die Sprache der Übe worden ist (nach Re	ersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht gel 55.2 und/oder 55.3).
3.	Hin: inte	sichtlich der in der int rnationale vorläufige	ernationalen Anmeldung offenbarten <b>Nucleotid- und/oder Aminosäuresequ</b> nz ist die Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:
		in der internationale	n Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
		zusammen mit der i	nternationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
		bei der Behörde nac	hträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
		bei der Behörde nac	hträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
		Die Erklärung, daß o Offenbarungsgehalt	das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
		Die Erklärung, daß o Sequenzprotokoll er	lie in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen itsprechen, wurde vorgelegt.
4.	Aufg	grund der Änderunge	n sind folgende Unterlagen fortgefallen:
		Beschreibung,	Seiten:
		Ansprüche,	Nr.:
		Zeichnungen,	Blatt:

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER **PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP02/07380

Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den 5. 🗆 angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)

- 6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:
- V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- 1. Feststellung

Neuheit (N)

Ja: Ansprüche 2,5-37

Erfinderische Tätigkeit (IS)

Nein: Ansprüche 1,3,4

Ansprüche 2,5 Ja:

Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)

Nein: Ansprüche 1,3,4,6-37

Ansprüche: 1-37

Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

#### Zu Punkt V

1) In diesem Bescheid werden die folgenden Dokumente (D) genannt:

D2: J. Chem. Res., Synop. (1982), (2), 46-7

D3: Bull. Soc. Chim. Fr. (1979), (9-10, Pt. 2), 552-8

D4: Tetrahedron (1977), 33(12), 1533-42

D5: Tetrahedron Lett. (1975), (43), 3737-40

D6: Farmaco, Societa Chimica Italiana, Pavia, It (1996), 1(51), 19-26

- 2) Die Anmeldung erfüllt nicht die Erfordernisse des Artikels 6 PCT, weil der Anspruch 1 nicht klar ist. Die Formel I gemäß Anspruch 1 umfaßt keine Verbindungen mit R1 = Tosyl, daher können solche Verbindungen auch nicht explizit ausgenommen werden.
- 3) Der Gegenstand der Ansprüche 1, 3 und 4 ist nicht neu (Artikel 33(2) PCT).
- 3.1) Die Verbindung 1.3b aus D2 fällt unter Anspruch 1 (R1 ist ein Phenyl- und Oxosubstituierter aliphatischer C1-Rest).
- 3.2) Die Verbindungen Benzamido-2 phényl-4 butanolide-4,

Benzamido-2 (méthyl-4' phényl)-4 butanolide-4,

Benzamido-2 (méthyl-3' phényl)-4 butanolide-4, und

Benzamido-2 (chloro-4' phényl)-4 butanolide-4,

aus D3 (vgl. Seite 556, linke Spalte) sind neuheitsschädlich (R1 ist ein Aryl- und Oxo-substituierter aliphatischer C1-Rest).

- 3.3) Die Verbindung 8c aus D4 (vgl. Seite 1534) ist neuheitsschädlich (R1 ist ein Phenyl- und Oxo-substituierter aliphatischer C1-Rest).
- 3.4) Die Verbindungen 9 aus D5 (vgl. Seite 3738) ist neuheitsschädlich (R1 ist ein Phenyl- und Oxo-substituierter aliphatischer C1-Rest).
- 4) Der neue Teil der Ansprüche 1, 3 und 4 beruht nicht auf einer erfinderischen Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT).

Als nächstliegender Stand der Technik wird D6 angesehen, welches die Verbindungen 6 und 7 im Zusammenhang mit der Aktivierung von NMDA Rezeptoren offenbart (vgl. Einleitung).

Als technische Aufgabe der vorliegenden Anmeldung wird die Bereitstellung von NMDA Antagonisten gesehen.

Die beanspruchten Verbindungen werden durch D6 nicht nahegelegt doch kann anhand der vorliegenden Daten nicht beurteilt werden, ob die Aufgabe gelöst worden ist.

Alle Beispiele weisen als Rest R1 eine Aryl- oder Heteroaryl- Gruppe auf, wovon die tatsächlich getesteten Verbindungen alle einen 3,5- Dichlorphenyl-Rest aufweisen. Mit Blick auf die große strukturelle Verwandtschaft der getesteten Verbindungen scheint es zweifelhaft, daß im wesentlichen alle beanspruchten Verbindungen ( zum Beispiel Verbindungen in denen R1 einen über eine Alkylengruppe gebundenen Aryl/Heteroarylrest, einen aliphatischen Rest oder einen cycloaliphatischen Rest darstellt) die Aufgabe lösen.

Außerdem scheint die Anzahl und Art der Substituenten unbeschränkt zu sein. Solche offenen Definitionen ohne Angabe der Natur der Substituenten können in der Regel nicht zugelassen werden. Selbst wenn eine grosse Anzahl Verbindungen getestet werden sollte, kann nicht gezeigt werden, daß alle theoretisch möglichen Verbindungen das Problem lösen

Um die Erfordernisse der Regel 5.1 a) ii) PCT zu erfüllen, ist in der Beschreibung 5) das Dokument D1 zu nennen, welches zur Maßgabe in Anspruch 1 Anlass gab.